

(C) WPI / DERWENT

XP-002392535

AN - 1978-05666A [25]

CPY - MATS-I

DC - B04

FS - CPI

IC - A61K35/78

MC - B04-A07F B12-G07

M1 - [01] V400 V406 P631 P633 P634 M781 R000 M423 M902

PA - (MATS-I) MATSUI T

PN - JP52145509 A 19771203 DW197803 000pp

PR - JP19760061362 19760527

XIC - A61K-035/78

AB - J52145509 Anti-cancer agent contains as effective ingredient a bitter principle of hops of *Humulus lupulus* L. (Moraceae). The anti-cancer effect is conc. in the cone of hops, partic. in the bitter principle of lupulin particles (contg. yeast for beer brewing) which contain mainly vegetable female hormone.

- Hop cones collected after 35-45 days from flowering are dried in the sand or under hot air at 40-60 degrees C for 5-15 hrs. until the moisture content is 10-20%. The resulting dry hop contains 6-17% moisture, 0.13-0.48% essential oil, 7-25% resin (water soluble resin contg. humulone and lupulin), 7-11% tannin, 10-17% nitrogenic cpd., 10-18% fibrous material, 5-10% ash and yeast. The dry hop is placed in a cloth bag and immersed in pure water in a ceramic pot or pressure pot at a rate of 5-10 g./l. at 60-65 degrees C for 1-3 hrs. and then at 90-100 degrees C for 30-60 secs., during which time the lost amt. of water is supplied little-by-little. The bag taken out of the water is allowed to cool. The resulting hop extract exhibits a bitter taste, shows strong permeability and antiseptic sterilisability to the mucous membrane and skin, promotes metabolism, and improves the circulation of the blood. The extract is effective in treatment of diabetes, hypertension and gastro enteric disorders without any adverse reaction. It is partic. effective against cancers of the stomach, bladder, liver, lung and breast.

IW - ANTICANCER AGENT BITTER PRINCIPLE HOP HUMULUS LUPULUS

IKW - ANTICANCER AGENT BITTER PRINCIPLE HOP HUMULUS LUPULUS

NC - 001

OPD - 1976-05-27

ORD - 1977-12-03

PAW - (MATS-I) MATSUI T

TI - Anticancer agent - including the bitter principle of hops of *Humulus lupulus*

THIS PAGE BLANK (USPS)

⑨日本国特許庁
公開特許公報

⑪特許出願公開
昭52—145509

⑩Int. Cl².
A 61 K 35/78

識別記号
ADU

⑫日本分類
30 A 31
30 H 52

厅内整理番号
6617—44
5727—44

⑬公開 昭和52年(1977)12月3日
発明の数 1
審査請求 有

(全 5 頁)

⑭がん治療薬

⑮特 願 昭51—61362

⑯出 願 昭51(1976)5月27日

⑰發 明 者 松井徳太郎

岐阜県吉城郡古川町幸栄町1番

43号

⑱出 願 人 松井徳太郎

岐阜県吉城郡古川町幸栄町1番
43号

⑲代 理 人 弁理士 恩田博宣

明細書

1. 発明の名称

がん治療薬

2. 特許請求の範囲

1. 藥科植物のホップの苦味成分を有効成分とするがん治療薬。

3. 発明の詳細な説明

本発明はホップの苦味成分を有効成分とするがん治療薬に関するものである。

近年、確病でしかも死亡率の高い胃がん、肺がん等のがん(癌)は世界中の学者が巨費を投じてその原因及び治療方法を研究中であるにもかかわらず、その発生原因はウイルスともいわれ、又、がん細胞ともいわれ、あるいは発がん物質ともいわれ、それら諸説のうちどれか正しいのかさえ確定しておらず、従つて、この原因不明のがんに対して著しい効果のある化学療法(薬剤)が発見されていない現状である。

今のところ、このがんを全治する最も有効な方法としては早期発見して外科的療法(手術)を用いる以外になく、一度ある一定の症状までがんが進む(転移)ともうどんな療法を用いても全治させることは不可能であつて、このために多くの尊い人命が失なわれてきた。

そして重症のがん患者に対しては化学療法以外に対処することができます。このため多くの薬剤が開発されたが、これらはいずれもがんを根治させるものではなく、さらにがんに特効のある薬剤はすべて人体に重大な副作用を誘発するためまだ無毒無害のがん治療薬は発見されていないのが実情であり、従つて無毒無害でしかも特効のあるがん治療薬の開発が医学上の大きな課題であつた。

ところで、出願人は酒類販売を永年営んでいるため、酒類のうちで、日本酒とビールとをそれぞれ飲用している多数の人々の健康状態を直接観察することができ、その結果日本酒ばかりを飲用し

5

10

15

15

特號 號52-145509 (2)

ビールの醸造に使用するホップは桑科に属するつる性の雌雄異株の多年生草本であつて、その栽培には年間平均気温が8.3～9.5°Cで、生育期間（4月～8月）の平均気温が14.5～17°Cで、夏の月平均気温20°Cを超えることのない比較的冷涼な温帯地方が適し、日本ではビールの醸造用として北海道、青森、秋田、山形、岩手、宮城、福島、群馬、山梨、新潟、長野等で栽培されてい

父。ホップは6月下旬から7月上旬にかけて開花しはじめ、特にビールの醸造に使用する雌花は中軸に多数の色が重なり合つて縮いた松かさ状の緑色球果で、開花後10日目頃から球果の内側と外側との基部にあるルブリジン腺毛から树脂性物質の分泌物がはじまり、その分泌物ははじめ無色で香がやがて淡黄色から透明な黃金色となり、これをルブリジン粒といつて球果の大部分のルブリジン粒が完成するのに開花後35~45日間かかるもの

り、これはホツップの球果を日光にさらすと特に前記ルブリーン粒が変質して有効成分が分解する危険があるためである。又、熟風乾燥による母台には、熟風の温度をあまり高くすると球果が褐色にこげてルブリーン粒に含まれる有効成分も少なくなるため、前記の温度範囲内で行なう必要があり、55℃の母台の熟風が最適である。

さらに、同熱風乾燥における所要時間は熱風温度を前記範囲内で高く設定すれば短くなるものである。熱風温度を55°C程度に設定した場合には、以実の菌が4~5時間程度で水分含量20%程度となり、6時間程度で10%程度となるが、中動では50%程度の水分を含んでいるため、さらに4時間程度の乾燥時間が必要であり、従つて、熱風乾燥の場合には55°C程度の熱風で10時間程度かかるのが最適である。

前記のようにして乾燥された乾燥ホップの成分
は水分 6~7%、醸油 0.33~0.48%、樹脂

てゐる人にはがんをはじめ高血圧、脳出血等の病気になる人があり、ビールばかりを飲用している人には、このビールのために死亡したり病氣になつたりする者が皆無で就中がんになる者が一人もないといふ統計的事実を知ることができた。

本発明は上記の事項からビールの中に含まれるホップががん群の病気を未然に防ぎかつ制圧するこのホップの球果を実験的に研究した結果、のではなかると考え、そのホップの球果特に植物性女性生殖ホルモンを主成分とするルブリジン粒(ビール醸造用酵母を含有する)の苦味成分に備れたがん治療効果があることが判り、この点に着目してなされたものである。

本発明はこの発見に基づいてなされたものであつて、癌れたがん治療効果を発揮するがん治療薬を供給することを目的とする。

本年明はこの目的を合理的に達成した技術的思想の創作である。

まず最初に、ホップの概要について説明する。

とされている。さらに、ビール醸造の有効成分は大部分がこのルブリン粒中に含まれており、このルブリン粒は女性生殖ホルモンを主成分とし特有の香氣とはなはだしい苦味をもつものである。

以下本発明を具体化したが一の実施態様を説明すると、本発明ではまず、ホップの球果を開花後35～45日で収穫する。この収穫時期は球果の内芯と外殻との基部に分泌されるルブリン粒が球果全体にわたって完成した時期であり、収穫時間が早い場合にはルブリン粒の分泌が不完全で有効成分を充分に得ることができず、又、収穫時間が遅れた場合にはルブリン粒が変質するとともに、その色も赤味をおびて変色し有効成分が分解するものであつて、特に開花後40日頃に収穫するものが好適である。

仄に前記の吸機したホップの球葉を陰干しで自
又は40~60℃熱風で5~15時間強制乾燥
後乾燥して、水分含量10~20%とする。前記
の自然乾燥による場合は必ず陰干しにすべきであ

7～25%、クシニン7～11%、全窒素物質10～17%、粗纖維10～18%、灰分5～10%、酵母を含有し、前記樹脂の中にはフミロン、ルブリソを含みこの樹脂は水溶性を有している。

次に前記のように自然乾燥又は熱風乾燥により水分含量10～20%に乾燥したホップの球果を布帛等で作つた袋に入れ、これを陶器製の土瓶又は高圧の鍋、蓋等を用いて5～10%の割合で清水内に浸し、蒸らす水分を徐々に補給しながら60～65°Cで1～3時間煮出した後に90～100°Cで30～60秒間煮立て、前記袋を取り出して自然冷却する。

この場合に使用する容器は前記のような陶器等の非金属性のものを用いる必要があり、これは例えば鉄製の容器を使用した場合にはホップの球果に含まれるタンニンが鉄と結合して不溶性のタンニン鉄となり、できあがつたホップエキス中にそのタンニン鉄ががん治療薬としての効果の全く

記の60～65°Cで1～3時間煮出する場合には、始めにホップの球果に対し前記の割合で水を入れ煮つまつたら水をそいで最終的に前記の割合となるようにするのが望ましい。

このように製造した煎膏状のホップエキスは苦味を呈し、粘膜及び皮膚に対し著しい透吸性と防腐殺菌力を有し、新陳代謝を促進して血行をよくする作用を有し、しかも人体には無毒無害であるといふ特性を有している。

なお、前記防腐殺菌力については次のような実験結果がある。

すなわち、900mlの生牛乳に前記ホップエキス5mlを混和して1ヶ月後に検査したところ、腐敗変質せず、カビの発生を見なかつたが、ホップエキスを添加しなかつた生牛乳はカビのコロニーが発生し綠カビが大量繁殖した。

なお、前記ホップエキスは糖尿病、高血圧、胃病等の諸病に効き目があらることが実験的に立証

特開昭52-145509(3)

ない不純物として混入するためである。又、ホップの球果と清水との割合は前記のように5～10%の範囲とするべきであり、ホップの球果の量がこれよりも少ないとできあがつたホップエキスが希釈で有効成分の少ないものとなり、又、ホップの球果の量をこれ以上多くしても清水中に溶出される有効成分の量が減らす、同球果中に残るものである。

さらに、前記の場合の加熱温度は、ホップの球果に含まれる有効成分の一種が60～65°Cで強めて溶出しやすく、又、有効成分のその外の一種が90～100°Cで溶出しやすい性質を有することが実験研究により判明したのでこの範囲内で煮出し及び煮立てするのが最適であり、その所要時間については前記範囲よりも少ない場合には有効成分が充分に溶出されず希釈なものとなり、逆に煮出し時間を多くしてもそれ以上の有効成分が溶出しないので、2時間程度が最適である。又、前

されている。

最後に前記ホップエキスを無害な薬用基剤に配合してがん治療薬を製造することができる。

このように無毒無害のホップにより製造したがん治療薬は全く副作用を心配することなくこれを一般の煎膏と同様に服用することができ、胃がん、肺腺がん、肝腫がん等各種のがんの治療に優れ効果を発揮することが実験研究の結果判明した。次にその二例を順次説明する。

(実験結果1)

岐阜県吉城郡古川町在住の農業Aさんは昭和47年9月から血尿ができるようになり、高山市のある病院で膀胱がんと診断された。翌年6月名大附属のがん研究所に入院し、イギリス式水圧療法を5回試みたが全治せず、同研究所において手術するよう勧められた。しかし、手術して死亡する患者を多く見てきたAさんは手術ではどうにもならないと考えて退院し、食事療法をすすめようになつた。

ところが当時 Aさんはホップよりなるがん治療薬が難病である糖尿病によくきくことを知っていたので、このがん治療薬を服用し始め約半年ほどで大分快方に向い、その後二年間継続して服用したことろ、益々快方に向い今日では元の体になりとのがん治療薬によりかなり重症であつた膀胱がんが全治した。

(実験結果 2)

岐阜県吉城郡古川町主婦 Bさんは昭和49年1月高山市のある病院にて胃がんの手術を受けたのち同年5月に退院し、自宅療養をしていた。それから Bさんは1年半ほど通院して次第に快方に向うようになつたが、50年7月ごろになつて胃がんが転移し舌がんになつたと診断された。そこで Bさんは5種類の外のがん治療薬を服用していたのですが、胃が悪くなつてついで服薬を中止しました。出向人がこの Bさんに前記のがん治療薬を服用させたところ、めきめきと快くたり1ヶ月し

し、この粉末状のホップをそのままがん治療薬とすること。又、この粉末状のホップを他の薬用基剤に配合してがん治療薬とすること。

この場合の作用効果は前記第一実施態様と同様である。

(イ) 又、前記ホップエキス又は粉末状のホップをそのままがん治療薬とする場合、あるいは他の薬用基剤に配合してがん治療薬とする場合には制がん剤等を添加すること。

(二) なお、本発明のもう一つの実施態様について説明する。

前記乾燥ホップを300メッシュの微粉に粉碎して陶磁器製の土瓶(1.8ℓ)に1.5ℓの水を入れ、この中に前記粉末ホップ5gを投入してよく攪拌し弱火のプロパンガスで2時間蒸出する。この間に全体の約1/3が減量するからこの量だけ差し水を行なつて最後に強火のプロパンガスで30秒間煮沸して火力を止め、1.5ℓの

て9月にはおかゆ食が食べられるようになり、2ヶ月して普通食となり3ヶ月して稻刈りの田園へ軽い仕事に出られるようになり、それからさらに元気がで健康なときと変わらない体に回復し全治した。

なお、本発明は前記第一実施態様に限定されるものではなく、次のような態様で具体化することも可能である。

(イ) 前記第一実施態様ではホップエキスを他の薬用基剤に配合して、煎藥状のがん治療薬としたが、前記ホップエキスをそのままがん治療薬とすること。この場合にも前記第一実施態様と同様の作用効果がある。

(ロ) 前記第一実施態様ではホップエキスを他の薬用基剤に配合して、がん治療薬としたが、これを前記のように自然乾燥又は熱風乾燥により水分含量10~20%に乾燥したホップの球果を粉碎機等により粉碎して粉末状のホップを製造

ヨリ

ホップエキスを調査し、このホップエキスをそのままあるいは他の薬用基剤に配合してがん治療薬を得た。

得られたがん治療薬は優れたがん制圧作用を有する。

(ハ) 前記実施態様では煎藥状、粉末状のがん治療薬を製造するようにしたが、これを飲みやすいように粒状にしたり、カプセル入りにしたりすること。

なお、前記実施態様ではがん治療薬を服用するようにしたが、これ以外に例えば、血液中に注射したり、皮膚に塗布したり、あるいは手術した疾患部の後に注入したりして使用することも可能である。又、がん患者以外の者に服用させ、がん予防薬として使用することも可能である。

以上詳述したように、本発明は桑科植物のホップの苦味成分を有効成分としたことにより、胃が

ん、肺がん、乳がん、肝臓がん等の各種のがん患者に対し、全く副作用を心配することなく投与して各種がんを治療することができる効果を有するので、がん治療薬として優れた発明である。

特許出願人 松井徳太郎
代理人 井理士恩田博宣

特開昭52-145509(5)

自発手続補正書

昭和51年 6月 24日

特許庁長官 片山石郎殿

1. 事件の表示

特開昭51-61862

2. 発明の名称

がん治療薬

3. 補正をする者

事件との関係 特許出願人

住所 松井徳太郎
氏名

4. 代理人

住所 ●500 岐阜市瑞龍町2番地
TEL 0582-65-1810

氏名 6875 井理士恩田博宣

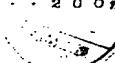
5. の日付

6. 補正の対象

明細書の発明の詳細な説明の欄

7. 補正の内容

明細書中第9頁第12行目の「...:900mlの

生牛乳に...」の記載を「...:200mlの生
牛乳に...」と補正します。

THIS PAGE BLANK (USPTO)